

## Notification of Reasons for Refusal

Patent Application Number	P2004-517272	
Drafting Date	July 3, 2009	
Examiner of the Patent Office	Yumiko Kawaguchi	9829 4C00
Agent for the Applicant	Mr. Kunihisa Ooie	
Applied Provisions	Patent Law Sections 29, main paragraph, 29(1), 29(2), 36 and 37	

This application should be refused for the reasons mentioned below. If the applicant has any argument against the reasons, such argument should be submitted within sixty days from the date on which this notification was dispatched.

### Reasons

1. This application does not comply with the requirements under the provision of Patent Law Section 37 on the points mentioned below.
2. Description of claims of this application does not comply with the requirements under the provision of Patent Law Section 36(6)(ii) on the points mentioned below.
3. Description of claims of this application does not comply with the requirements under the provision of Patent Law Section 36(6)(i) on the points mentioned below.
4. Description of Detailed Description of the Invention of this application does not comply with the requirements under the provision of Patent Law Section 36(4)(i) on the points mentioned below.
5. The invention in the claims listed below of this application should not be granted a patent under the provision of Patent Law Section 29(1)(iii) since it is an invention described in the publications listed below which were distributed in Japan or foreign countries or is an invention being able to be utilized to the public via telecommunication line prior to the filing of this application.
6. The invention in the claims listed below of this application should not be granted a patent under the provision of Patent Law Section 29(2) since it could have easily been made by persons who have common knowledge in the technical field to which the invention pertains, on the basis of the inventions described in the publications listed below which were distributed in Japan or foreign countries or those being able to be utilized to the public via telecommunication line prior to the filing of this application.

Note (List of Cited Documents is shown below)

This application is contrary to the stipulation of Patent Law Section 37 as mentioned in the following (1) and (2) and, therefore, with regard to the invention in claims 1 to 9, 16, 18, 19, 21, 22, 24 to 31, 44 to 60 and 66 to 70, no examination has been conducted for the requirements other than those stipulated by Patent Law Section 37.

As mentioned in the following (8), it is clear that the invention in claims 61 to 65 is an invention which does not correspond to an industrially applicable invention and, therefore, no examination has been conducted therefor concerning the requirements of novelty, inventive step, and the like.

(1) About the reason 1 / claims 1 to 9

The problem that the invention mentioned in claim 10 is to solve is to obtain the compound represented by the formula (I) while the problem that the invention mentioned in claims 1 to 9 is to solve is to obtain a drug comprising an EDG-5 regulator. Accordingly, with regard to the invention mentioned in claim 10 and the invention mentioned in claims 1 to 9, the problems that the inventions are to solve are not same whereby those inventions do not have the relation stipulated by Patent Law Section 37(i).

Further, the principal part of the invention mentioned in claim 10 is the compound represented by the formula (I) while the principal part of the invention mentioned in claims 1 to 9 is a drug comprising an EDG-5 regulator. Accordingly, with regard to the invention mentioned in claim 10 and the invention mentioned in claims 1 to 9, their principal parts are different whereby those inventions do not have the relation stipulated by Patent Law Section 37(ii).

Furthermore, those inventions do not comply with any of the relations stipulated by Patent Law Sections 37(iii), (iv) and (v).

Incidentally, although the compounds represented by the formula (I) are the constituting ingredients in claims 6 and 7, said compounds include many known compounds and such a point does not contribute in the prior art.

(2) About the reason 1 / Claims 16, 18, 19, 21, 22, 24 to 31, 44 to 60 and 66 to 70

The invention in claim 10 and the invention in the above-identified claims have the common technical characteristic feature that the compound represented by the formula (I) is a constituting ingredient. However, said characteristic feature includes so many known compounds such as the compounds mentioned in the cited documents 1 to 3 (even the result where the structural formula corresponding to claim 20 was searched using Registry and CA Plus, not less than one thousand known documents were found) and, since said characteristic feature does not result in the contribution to the prior art, it is unable to be said to be a

special technical characteristic feature. In addition, there is no other same or corresponding special technical characteristic feature.

Accordingly, the invention in claim 10 and the invention in the above claims have no same or corresponding technical characteristic feature and this application does not comply with the requirements under Patent Law Section 37.

Incidentally, in conducting the judgment for the unity, the specified invention was selected so that the numbers of the claims satisfying the unity become most abundant.

(3) About the reason 2 / Claims 10 to 15

In the compound mentioned in claim 10, all of the substituents A, X, Y, Z and B are variable groups and, therefore, it cannot be regarded that all of the choices for the compound mentioned in the claim have important chemical structure elements which are common to all of them.

In addition, it is unable to be predicted from the knowledge in the related technical field that a group of compounds mentioned in claim 10 acts in the same manner and, further, said group does not belong to a group of the compounds which is able to be recognized as a single group.

Accordingly, the choices or alternatives of the compound mentioned in claim 10 have no similar property or function and it is unable to grasp a single invention from the description of the claim.

That is also the same for claims 11 to 15 and the choices or alternatives of the compound mentioned in those claims have no similar property or function and it is unable to grasp a single invention from the description of the claims.

(4) About the reason 2 / Claims 10 to 15, 17, 20, 23 and 32 to 43

Due to the descriptions reading "substituent(s)" and "substituted", the scope of the invention is not clear.

(5) About the reasons 3 and 4 / Claims 10 to 15, 17, 20, 23 and 32 to 43

In the above claims, so many compounds having very broad chemical structure range are mentioned while the compounds which are actually produced in the Detailed Description of the Invention are only a few of them and, further, that where the pharmacological action is confirmed is just one compound, i.e. 4-(4-bromophenyl)-4-hydroxy-N-(3-(trifluoromethyl)phenyl)-1-piperidinecarboxamide.

The invention in the above claims covers the compounds having very broad chemical structure range and, therefore, it is not recognized that all of such compounds are produced by the same process as that in the working examples and have the same pharmacological activity.

Accordingly, the invention is not mentioned therein in such a manner that persons skilled in the art are able to carry out.

Further, it is beyond the scope which is disclosed as an invention in the Detailed Description of the Invention.

(6) About the reason 5 / Claims 10 to 15, 17, 20, 23, 32, 33, 35, 38, 39, 41 and 42 / Cited documents 1 to 3

The compound in Example 160 of the cited document 1 corresponds to the invention in claims 10 to 15, 17, 20, 23, 38, 39 and 41.

The compound in Example 354 of the cited document 2 corresponds to the invention in claims 10 to 15, 17, 20, 23, 38, 39 and 41.

The compound in Example 343 of the cited document 2 corresponds to the invention in claims 10 to 15, 17, 20, 23, 32, 33 and 35.

The compounds mentioned in lines 35 and 36, page 47, of the cited document 3 correspond to the invention in claims 10 to 15, 17, 20, 23, 38, 39, 41 and 42.

(7) About the reason 6 / Claims 10 to 15, 17, 20, 23 and 32 to 43 / Cited documents 1 to 3

Modification of a chemical structure within a range where the activity is available on the basis of the invention mentioned in the cited documents 1 to 3 is such a thing that which is carried out by persons skilled in the art within a usual technical creation.

Moreover, even when the Detailed Description of the Invention of this application and the technical common knowledge are taken into consideration, the invention in the above claims covers so many compounds which do not achieve the effect of the invention of this application and, therefore, the invention of this application does not achieve the particularly significant effect.

(8) About the reason 7 / Claims 61 to 65

The invention in claims 61 to 65 is unable to be granted a patent since said invention corresponds to a method of treatment of human whereby it does not correspond to an "industrially applicable invention" which is stipulated in the main paragraph of Section 29(1) of the Patent Law.

#### List of Cited Documents

1. Gazette of Japanese Laid-Open Patent No. 2002-003370
2. Pamphlet of International Publication WO 01/97786
3. Pamphlet of International Publication WO 02/05819

---

Record of Prior Art Search Result

. Technical Field Searched    IPC                : C 07 D 211/00, A 61 K 45/00

DB Names : REGISTRY/CAPlus (STN)

. Prior Art Documents    Gazette of Japanese Laid-Open Patent No. 2001-261575

Pamphlet of International Publication WO 01/98301

This record of prior art search result does not constitute the reasons for refusal.

---

Any inquiry for the content of this Notification of Reasons for Refusal should be addressed to the following official.

Yumiko Kawaguchi

Medical Science Section

Third Examination Department for Patents

Telephone:        03 (3581) 1101 (Ext. 3451)

Facsimile:        03 (3581) 1342

P.1

## 拒絶理由通知書

特許出願の番号	特願2004-517272
起案日	平成21年 7月 3日
特許庁審査官	川口 裕美子 9829 4C00
特許出願人代理人	大家 邦久 様
適用条文	第29条柱書、第29条第1項、第29条第2項、第36条、第37条

この出願は、次の理由によって拒絶をすべきものです。これについて意見がありましたら、この通知書の発送の日から60日以内に意見書を提出してください。

## 理 由

1. この出願は、下記の点で特許法第37条に規定する要件を満たしていない。
2. この出願は、特許請求の範囲の記載が下記の点で、特許法第36条第6項第2号に規定する要件を満たしていない。
3. この出願は、特許請求の範囲の記載が下記の点で、特許法第36条第6項第1号に規定する要件を満たしていない。
4. この出願は、発明の詳細な説明の記載が下記の点で、特許法第36条第4項第1号に規定する要件を満たしていない。
5. この出願の下記の請求項に係る発明は、その出願前に日本国内又は外国において、頒布された下記の刊行物に記載された発明又は電気通信回線を通じて公衆に利用可能となった発明であるから、特許法第29条第1項第3号に該当し、特許を受けることができない。
6. この出願の下記の請求項に係る発明は、その出願前に日本国内又は外国において頒布された下記の刊行物に記載された発明又は電気通信回線を通じて公衆に利用可能となった発明に基いて、その出願前にその発明の属する技術の分野における通常の知識を有する者が容易に発明をすることができたものであるから、特許法第29条第2項の規定により特許を受けることができない。

P.2

記 (引用文献等については引用文献等一覧参照)

この出願は下記(1)(2)のとおり、特許法第37条の規定に違反しているので、請求項1-9, 16, 18, 19, 21, 22, 24-31, 44-60, 66-70に係る発明については特許法第37条以外の要件についての審査を行っていない。

下記(8)のとおり、請求項61-65に係る発明は、産業上利用することができる発明に該当しないことが明らかである発明であるので、新規性・進歩性等の特許要件についての審査をしていない。

(1) 理由1について／請求項1-9

請求項10に記載される発明が解決しようとする課題は、一般式(I)で表される化合物を得ることであり、請求項1-9に記載される発明が解決しようとする課題は、EDG-5調節剤からなる医薬を得ることであると認められる。よって、請求項10に記載される発明と請求項1-9に記載される発明は、それぞれの解決しようとする課題が同一でなく、特許法第37条第1号に規定する関係を有するとは認められない。

また、請求項10に記載される発明の主要部は、一般式(I)で表される化合物であり、請求項1-9に記載される発明の主要部は、EDG-5調節剤からなる医薬であると認められる。よって、請求項10に記載される発明と請求項1-9に記載される発明は、それぞれの主要部が相違するから、特許法第37条第2号に規定する関係を有するとは認められない。

さらに、各発明は、特許法第37条第3号、第4号、第5号に規定する関係のいずれを満たすものとも認められない。

なお、請求項6, 7においては、一般式(I)で表される化合物を構成成分とするものの、当該化合物は多数の公知化合物を包含するものであり、この点が先行技術に貢献をもたらすものとは認められない。

(2) 理由1について／請求項16, 18, 19, 21, 22, 24-31, 44-60, 66-70

請求項10に係る発明と、上記請求項に係る発明とは、一般式(I)で表される化合物を構成成分とするという共通の技術的特徴を有している。しかしながら、当該技術的特徴は、文献1-3に記載された化合物をはじめ、非常に多数の公知化合物を包含するものであり(請求項20に対応する構造式をRegistry及びCAPlusを利用して検索した結果でさえ、1000件以上の公知文献が存在する)、先行技術に対する貢献をもたらすものではないから、特別な技術的特徴であるとはいえない。また、ほかに同一のまたは対応する特別な技術的特徴が存在しない。

P. 3

したがって、請求項 10 に係る発明と、上記請求項に係る発明とは、同一の又は対応する特別な技術的特徴を有しておらず、この出願は、特許法第 37 条に規定する要件を満たさない。

なお、単一性の判断をするに当たっては、単一性を満たす請求項が最も多くなるように、特定発明を認定した。

(3) 理由 2 について／請求項 10-15

請求項 10 に記載された化合物は置換基 A、X、Y、Z、B の各々がすべて可変の基であるから、請求項に記載された化合物のすべての選択肢が重要な化学構造要素を共有しているものとは認められない。

また、請求項 10 に記載された化合物群が、その技術分野における知識からは同じように作用するとは予測できず、一群のものとして認識される化合物群に属するものとも認められない。

したがって、請求項 10 に記載された化合物の選択肢どうしが類似の性質又は機能を有するとは認められず、請求項の記載から一の発明を把握できない。

請求項 11-15 についても同様に、化合物の選択肢どうしが類似の性質又は機能を有するとは認められず、請求項の記載から一の発明を把握できない。

(4) 理由 2 について／請求項 10-15, 17, 20, 23, 32-43

「置換基」「置換された」との記載により、発明の範囲が不明確である。

(5) 理由 3, 4 について／請求項 10-15, 17, 20, 23, 32-43  
上記請求項には、非常に広範な化学構造を有する、非常に多数の化合物が記載されているところ、発明の詳細な説明において、実際に製造されている化合物はそのうちのごく一部の化合物であり、さらに、薬理作用が確認されているのは、4-(4-プロモフェニル)-4-ヒドロキシ-N-(3-(トリフルオロメチル)フェニル)-1-ピペリジンカルボキサミドのただ 1 つのみである。

上記請求項に係る発明は、非常に広範な化学構造を有する化合物を包含することから、その全てが実施例と同様の方法により製造され、また、同様の薬理活性を有するものとは認められない。

したがって、当業者が実施できる程度に発明が記載されていない。

また、詳細な説明において、発明として開示された範囲を超えている。

(6) 理由 5 について／請求項 10-15, 17, 20, 23, 32, 33, 35, 38, 39, 41, 42／引用文献 1-3

引用文献 1 の実施例 160 の化合物は、請求項 10-15, 17, 20, 23, 38, 39, 41 に係る発明に相当するものである。

引用文献 2 の実施例 354 の化合物は、請求項 10-15, 17, 20, 23



P. 4

、 38、39、41に係る発明に相当するものである。

引用文献2の実施例343の化合物は、請求項10-15、17、20、23、32、33、35に係る発明に相当するものである。

引用文献3の第47頁35、36行に記載された化合物は、請求項10-15、17、20、23、38、39、41、42に係る発明に相当するものである。

(7) 理由6について／請求項10-15、17、20、23、32-43／引用文献1-3

引用文献1-3に記載された発明に基づき、活性を有する範囲で化学構造を変化させてみることは、当業者が通常の技術的創作において行うものである。

また、本願の発明の詳細な説明及び技術常識を考慮しても、上記請求項に係る発明は、非常に多数の本願発明の効果を有さない化合物を包含するものであるから、本願発明が格別顕著な効果を奏するとは認められない。

(8) 理由7について／請求項61-65

請求項61-65に係る発明は、人間を治療する方法に該当するので、特許法第29条第1項柱書に規定する「産業上利用することができる発明」に該当しないため、特許を受けることができない。

#### 引用文献等一覧

1. 特開2002-003370号公報
2. 国際公開第01/97786号パンフレット
3. 国際公開第02/05819号パンフレット

---

#### 先行技術文献調査結果の記録

・調査した分野   IPC       C07D 211/00, A61K45/00  
DB名       REGISTRY/CAPlus (STN)

・先行技術文献   特開2001-261575号公報  
                  国際公開第01/98301号パンフレット

この先行技術文献調査結果の記録は、拒絶理由を構成するものではない。

---

この拒絶理由通知の内容に関する問い合わせ先

特許審査第三部 医療   川口 裕美子  
TEL 03(3581)1101 ext. 3451  
FAX 03(3581)1342